中藥藥理學

解表藥

- 以發散表邪、解除表證為主要作用的藥物。
- 功效
  - 發汗解表，利水消腫、止咳平喘、透發疹毒、緩解疼痛等效應。
- 主治
  - 外感表證，水腫、痲疹、風疹、咳喘、風濕痺痛等證而兼有表證者。
- 表證：分為表寒證和表熱證。
- 解表藥根據藥性和功效的不同，分為：
  - 辛溫解表藥 (發散風寒藥)：藥性多屬辛溫，主治風寒表證
  - 辛涼解表藥 (發散風熱藥)：藥性多屬辛涼，主治風熱表證

表證

- 外邪侵犯人體的淺表部位所致的一類證候。
- 臨床表現
  - 惡寒(或惡風)、發熱、全身酸痛、鼻塞、噴嚏、無汗或有汗、流鼻涕、咳嗽、咽喉癢痛、舌苔薄白、脈浮數等。
  - 症狀與上呼吸道感染(感冒、流感)、急性傳染病及急性感染性疾病初期的症候群十分相似。

表證

- 中醫理論：有一分惡寒，便有一分表證。
  - 惡寒是診斷表證的重要依據。
- 產生惡寒症狀的原因：皮膚血流量減少，皮膚溫度降低
- 上呼吸道感染的重要發病原因之一在於機體受涼
  - 當寒冷刺激作用於機體時，可引起皮膚血管收縮，同時致上呼吸道黏膜血管反射性收縮，導致黏膜局部缺血，抵抗力下降，
  - 造成在上呼吸道的病原微生物(細菌、病毒等)乘機侵入黏膜上皮細胞生長繁殖，導致炎症反應而出現諸多臨床症狀。

功效與主治

- 解表藥：
  - 偏行肌表，能促進肌體發汗，使表邪由汗出而解或從外而散，達到治愈表證，防止疾病傳變的目的
    - 即內經所謂:“其在皮者，汗而發之” 之意。
  - 主要用以治療由風邪為主的六淫外邪引起的表證，症見發熱、惡風寒、頭身疼痛、脈浮等。
    - 亦具有祛風止癢和祛風通竅等功效，
  - 主治風邪鬱閉肌表引起的皮膚痛癢，或風邪內犯鼻竅引起的鼻塞、流涕等症。
- 部分藥物還可以祛風邪以利咽喉，主治風邪所致的咽癢、咽痛、發音不利等症。

解表藥的藥理作用

1.發汗作用

- 一般都具有發汗或者促進發汗的作用，使表邪從汗而解，
  - 內經：其在皮者，汗而發之，體若燔碳，汗出而散。
- 以辛溫解表藥發汗作用較強。
- 現代醫學將出汗分為溫熱性發汗和精神性發汗。
- 解表藥所引起的發汗多屬於溫熱性發汗。其依據是
  - 辛溫解表藥服用後身體自我感覺有溫熱感；
  - 麻黃鹼能使處於高溫環境中的人出汗快而多
  - 服用麻黃湯、桂枝湯後強調“溫服”和“溫覆”。
- 發汗作用機制可能包括：
  - 直接影響汗腺功能，增加汗液分泌。
  - 透過促進或改善血液循環而促進發汗。
  - 興奮汗腺受體，使汗腺分泌增加。

2.解熱作用

- 能使實驗性發熱動物的體溫降低，
  - 柴胡、桂枝、荊芥、防風、葛根、銀翹散、桑菊飲、麻杏石甘湯、九味羌活湯等。
- 麻黃揮發油、柴胡皂苷、葛根素、桂枝煎劑、細辛揮發油可使正常動物的體溫下降。
- 解表藥解熱(或降溫)作用機制：
  - 發汗或促進發汗；
  - 擴張皮膚黏膜血管增加散熱；
  - 影響腦內活性物質(如cAMP)進而影響中樞的體溫調節功能；
  - 抗發炎、抗病原微生物。

3.抗病原微生物作用

- 表證是由外邪（細菌、病毒、低溫、高溫等）客表所致。
- 麻黃、桂枝、防風、細辛、生薑、柴胡、薄荷、牛旁子等對多種細菌(如金黃色葡萄球菌、肺炎球菌、溶血性鏈球菌、大腸桿菌、傷寒桿菌、痢疾桿菌等)及某些致病性皮膚真菌均具有不同程度的抑制作用；
- 麻黃、桂枝、柴胡、桂枝湯等對呼吸道病毒等亦有一定的抑制作用。
- 本類藥或相關方藥臨床應用於治療上呼吸道感染確有較好的效果。

4.鎮痛、鎮靜作用

- 頭身痛、肌肉關節酸痛是表證的常見症狀。
- 柴胡、桂枝、藁本、白芷、防風、羌活、細辛、桂枝湯、九味羌活湯等對多種實驗性疼痛動物模型，均有明顯的鎮痛作用。
- 鎮痛作用部位多數在週邊，部分藥物(如細辛)透過作用於中樞發揮效應。
- 多數解表藥均具有程度不等的鎮靜作用，可使動物自主活動減少或能加強中樞抑制藥的作用
  - 桑菊飲、柴葛解肌湯、升麻葛根湯有類似作用。

5. 抗發炎作用

- 呼吸道炎症是表證的常見症狀。
  - 柴胡、麻黃、生薑、辛夷、細辛、桂枝湯、銀翹散、桑菊飲等對多種實驗性炎症均有明顯的抑制作用。
- 本類藥可能抗發炎機制：
  - 抑制花生四烯酸代謝
  - 抑制組織胺或其他炎性介質生成或釋放
  - 增強腎上腺皮質軸功能
  - 清除自由基

6.調節免疫作用

- 柴胡、葛根、蘇葉、麻黃湯、麻杏石甘湯、桂枝湯等均可通過提高機體的非特異性免疫功能，有利於解除表證
- 麻黃、桂枝、小青龍湯、葛根湯
  - 對過敏反應具有抑制作用，可緩解和治療過敏性疾病。

麻黃

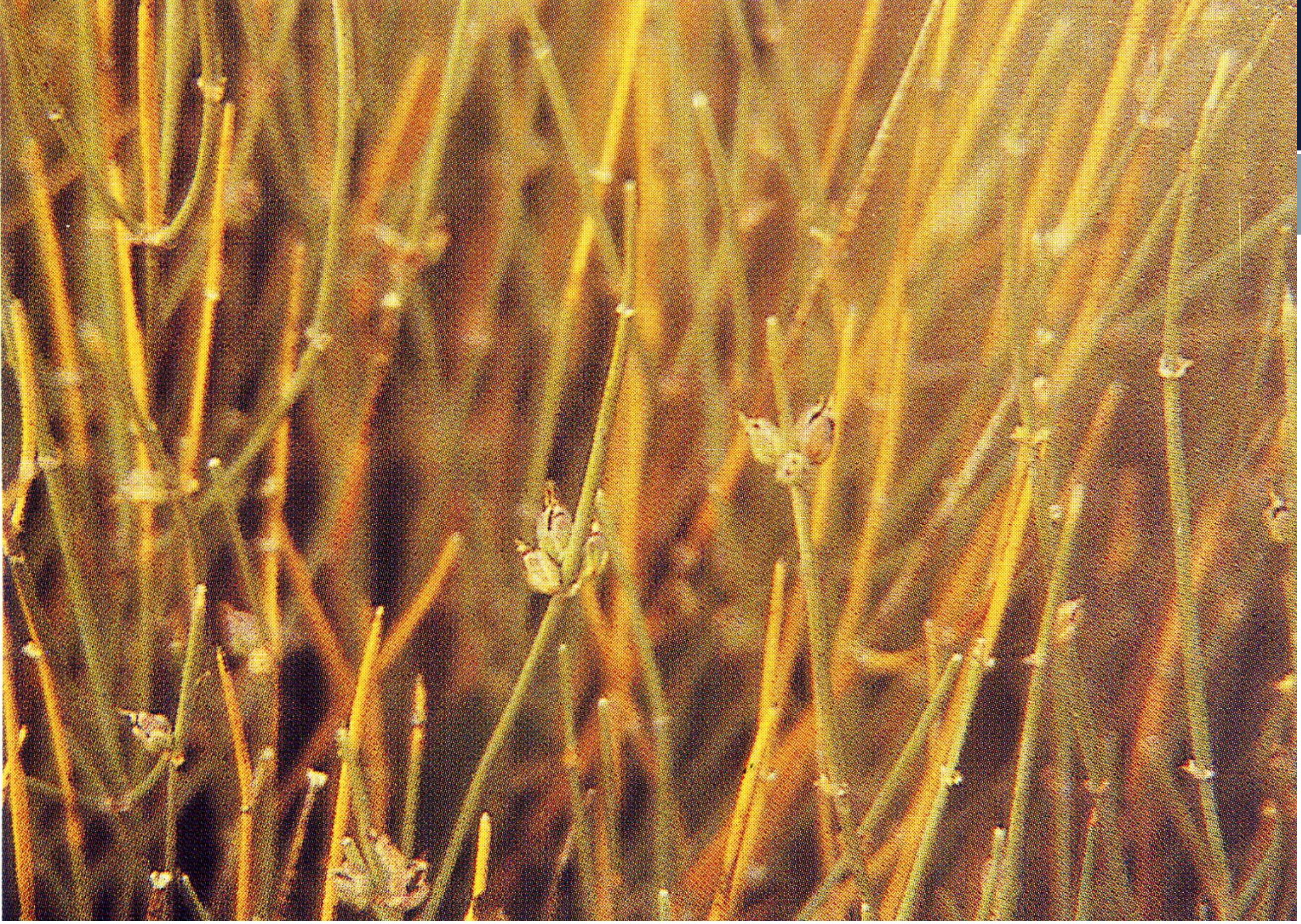
- 麻黃科植物的乾燥草質莖。
  - 草麻黃 Ephedra sinica Stapf.
  - 中麻黃 E. intermedia Schrenk et C. A. Mey.
  - 木賊麻黃E. equisetina Bge.
- 味辛、微苦，性溫。歸肺、膀胱經。

麻黃

- 主要成分：
  - 生物鹼 (1~2%) 。
    - 80%-85%為麻黃鹼 (L-ephedrine)
      - 其次為偽麻黃鹼 (D-pseudoephedrine)及微量的L-N-甲基麻黃鹼 (L-N-methyl-ephedrine)、D-N-甲基偽麻黃鹼 (D-N-methyl-pseudoephedrine)、去甲基麻黃鹼 (L-nor-ephedrine)、去甲基偽麻黃鹼 (D-nor-pseudoephedrine)和麻黃次鹼 (ephedine，麻黃定)等
  - 少量揮發油，油中含α-松油醇 (α-terpineol，萜品烯醇)、2, 3, 5, 6- tetramethylpyrazine
  - 鞣質

草麻黄

Ephedra sinica Stapf.



中麻黄

E. intermedia Schrenk et C. A. Mey.

木賊麻黄

Ehedra equisetina Bge.

與功效主治相關的藥理作用

- 功效
  - 發汗散寒、宣肺平喘、利水消腫。
- 主治
  - 風寒感冒，胸悶喘咳，風水浮腫。
- 本草正義：
  - 麻黃清輕上浮，專疏肺鬱，宣泄氣機，為治感第一要藥，雖曰解表，實為開肺，雖曰散寒，實為泄邪，風寒固得之而外散，……後人以麻黃治水腫氣喘，小便不利諸法，雖曰皆取解表，然以開在內之閉塞，非以逐在外之感邪也。

(1)發汗

- 歷代醫家利用其發汗作用治療風寒束表、腠理閉塞、肺氣不宣、發熱無汗的表實證。
- 麻黃為辛溫解表之峻品。
- 近代實驗研究證實，麻黃水煎劑、麻黃水溶性提取物、麻黃揮發油、麻黃鹼、L-甲基麻黃鹼等均有發汗作用。
- 發汗作用特點
  - 作用強、起效快、維持時間長。
- 發汗作用可能機制：
  - 阻礙汗腺對鈉離子的重吸收，致使水分瀦留於汗腺管腔，引起汗液分泌增加
  - 興奮汗腺α受體，使汗腺分泌增加
  - 透過興奮中樞神經系統有關部位而產生效應

影響麻黃發汗作用的因素

- 溫服有助於麻黃發汗
- 人體處於溫熱環境時，麻黃鹼促進汗腺分泌的作用更加顯著
- 藥物配伍：
  - 配伍桂枝後發汗作用明顯增強
- 在麻醉狀態下，發汗作用減弱，局部神經損傷，也可影響其發汗作用，可見該作用與中樞神經系統功能有關。
- 藥用部位
  - 麻黃根有止汗作用。

(2)平喘

- 麻黃鹼、偽麻黃鹼、麻黃揮發油、2, 3, 5, 6-四甲基吡嗪和萜品烯醇是其平喘的有效成分。
- 麻黃鹼化學性質穩定，口服有效。平喘作用起效較慢，作用溫和，作用維持時間持久。

(2)平喘

- 麻黃平喘作用機制：
  - 直接興奮支氣管平滑肌的β受體，激活腺苷酸環化酶(adenyl cyclase)，升高細胞內cAMP，使平滑肌鬆弛；
  - 直接興奮支氣管黏膜血管平滑肌的α受體，使血管收縮，降低血管壁通透性，減輕支氣管黏膜水腫；
  - 促進腎上腺素能神經末梢和腎上腺髓質嗜鉻細胞釋放遞質而間接發揮擬腎上腺素作用；
  - 阻止過敏介質釋放。
    - 麻黃水提取物和乙醇提取物能抑制過敏介質 (5-羥色胺、組織胺、白三烯)的釋放。

(3)利尿

- 麻黃的多種成分均具有利尿作用，以D-偽麻黃鹼作用最顯著。
- 麻黃生物鹼靜脈注射給藥利尿作用明顯，而口服用藥作用較弱。靜脈給藥後，作用出現快，一次給藥作用可維持0.5-1.0小時。
- 麻黃利尿作用強度有限，超過一定劑量後作用反而減弱。
- 利尿作用可能機制：
  - 擴張腎血管增加腎血流量，使腎小球濾過率增加，
  - 影響腎小管重吸收功能，阻礙腎小管對鈉離子的重吸收。

(4)解熱、抗發炎

- 麻黃揮發油對多種實驗性發熱動物模型有解熱效應，對正常小鼠體溫有降低作用。
- 麻黃的多種成分、多種製劑(麻黃水提取物、醇提取物)均有抗發炎作用，以偽麻黃鹼作用最強。
- 近年來從麻黃中分離到的雜環化合物(如ephedroxene)也具有抗發炎活性。
- 麻黃抗發炎作用機制：
  - 抑制炎症早期的血管通透性增加；
  - 抑制炎症後期肉芽組織的形成；
  - 對抗致炎物質的作用。
  - 可能與抑制花生四烯酸的釋放與代謝有關。

抗過敏反應作用

- 麻黃鹼能抑制過敏介質釋放，
- 麻黃水提取物及醇提取物可以降低血清溶血素(hemolysin)濃度，並具有抗補體作用。

(5)抗病原微生物

- 麻黃揮發油：
  - 對金黃色葡萄球菌、甲型及乙型溶血性鏈球菌、流感嗜血桿菌、肺炎雙球菌、炭疽桿菌、白喉桿菌、大腸桿菌、奈瑟雙球菌等均有不同程度的抑制作用。
  - 對亞甲型流感病毒有明顯抑制作用。

(6)鎮咳祛痰

- 麻黃鹼、麻黃水提取物給動物灌服，可明顯抑制二氧化硫和機械刺激所致的咳嗽反射，其鎮咳強度約為可待因(codeine)的1/20。
- 萜品烯醇是鎮咳有效成分之一。
- 麻黃揮發油灌胃具有一定的祛痰作用。

其他藥理作用

(1)興奮中樞神經系統

- 麻黃鹼脂溶性高，易於透過血腦屏障 (Blood-Brain Barrier)，在治療劑量：
  - 能興奮大腦皮層和皮層下中樞，引起精神興奮、失眠等症狀，
  - 能興奮中腦、延腦呼吸中樞和血管運動中樞

(2)強心、升高血壓

- 麻黃鹼能直接和間接興奮腎上腺素能神經受體，對心臟具有正性肌力、正性頻率作用；能收縮血管，使血壓升高。
- 升壓作用特點為作用緩慢、溫和、持久，反覆應用易產生快速耐受性。

(3)抑制腸平滑肌收縮

- 麻黃鹼：
  - 對離體豚鼠回腸的自發性收縮有抑制作用，
  - 對抗乙醯膽鹼和5-羥色胺的收縮效應。

綜述

- 發汗散寒功效的藥理學依據：發汗、解熱、抗病原微生物、抗發炎、抗過敏等作用；
- 宣肺平喘的藥理學基礎：緩解支氣管平滑肌痙攣，減輕黏膜水腫、抗發炎、抗過敏、鎮咳、祛痰等作用
- 消除水腫的功效與利尿作用相關
- 主要有效成分是生物鹼。

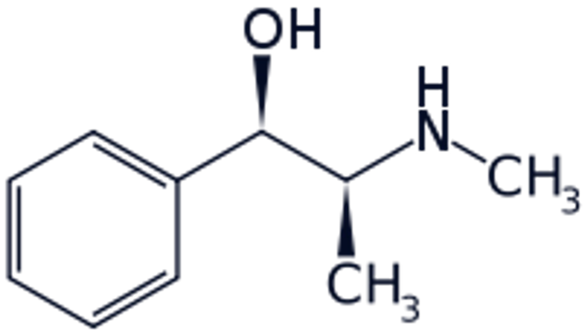
現代應用

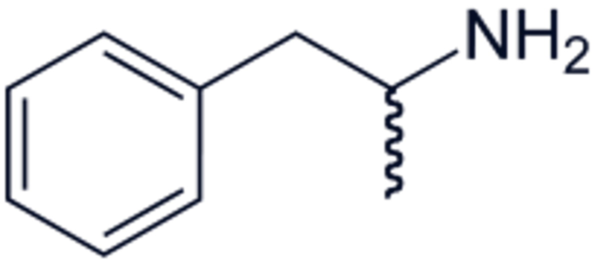
- 感冒
- 支氣管哮喘
  - 用於預防哮喘發作有效，重症急性發作效果較差。
- 預防某些低血壓狀態
- 鼻塞
- 腎炎
  - 改善腎炎所致的全身浮腫症狀有效。

不良反應(1)

- 麻黃鹼可引起煩躁不安、失眠、心悸、高血壓等。高血壓、心臟病患者應避免使用，老年人慎用。不可與咖啡因配伍使用。
- 去甲基麻黃鹼（苯丙醇胺）因長期使用會增加中風的危險在2000年被禁用。
- 麻黃鹼為易製安毒原料。

Ephedrine v.s. Amphetamine





不良反應(2)

- 麻黃鹼的毒性大於偽麻黃鹼，可引起小鼠眼球突出，舉尾反應，紫紺，眼眶內出血等。
- 麻黃水提取物小鼠腹腔注射的LD50為650 mg/kg；麻黃揮發油小鼠灌胃、腹腔注射LD50分別為2.79 mg/kg和1.35 mg/kg。

桂枝

- 樟科植物
  - 肉桂Cinnamomum cassia Presl.的乾燥嫩枝。
- 有效成分：
  - 揮發油 (桂皮油)，含量為0.43%-1.35%。
    - 主要成分為桂皮醛 (cinnamic aldehyde)，約占69.2.0%-78.75%；
    - 桂皮酸 (cinnamic acid)及少量乙酸桂皮酯(cinnamyl acetate)、乙酸苯丙酯(phenylpmpy acetate)。
  - 反式桂皮酸 (trans-cinnamic acid)、香豆素(Coumarin)、原兒茶酸 (proto-catechuic acid)。
- 味辛、甘，性溫。歸心、肺、膀胱經。

肉桂

Cinnamomum cassia Presl.

與功效主治相關的藥理作用

- 功效：發汗解肌、溫通經脈。
- 主治：風寒感冒，脘腹冷痛，血寒經閉，關節痺痛，痰飲，水腫，心悸，奔豚。
- 本草匯言：桂枝，散風寒，逐表邪，發邪汗，止咳嗽，去肢節間風痛之藥也。
- 本草綱目：桂枝透達營衛，故能解肌而風邪去，脾主營，肺主衛，甘走脾，辛走肺也。

(1)擴張血管促發汗

- 桂枝單獨應用發汗作用較弱，若與麻黃伍用，則發汗力增強。
- 桂皮油
  - 能擴張血管，改善血液循環，促使血液流向體表，有利於發汗和散熱。

(2)解熱、鎮痛

- 桂枝煎劑、桂皮醛、桂皮酸、桂枝湯對實驗性發熱家免具有解熱作用，並能降低正常小鼠的體溫和皮膚溫度。
  - 解熱和降溫作用可能在於擴張皮膚血管，使機體散熱增加及促進發汗的結果。
- 桂枝煎劑或桂枝水提取物加總揮發油給小鼠灌服，能提升動物疼痛閥值。

(3)抗發炎、抗過敏

- 桂枝煎劑、桂枝揮發油對多種致炎物質所致的急性炎症具有抑制作用，可明顯降低血管通透性。
- 抗發炎作用機制：
  - 抑制組織胺生成
  - 抑制前列腺素E的合成釋放
  - 清除自由基
- 桂枝能抑制IgE所致肥大細胞脫顆粒作用，減少過敏介質釋放，並能抑制補體活性。
- 揮發油
  - 對大鼠佐劑性關節炎有抑制效應。

(4)抗病原微生物

- 桂枝醇提取物
  - 對金黃色葡萄球菌、大腸桿菌、肺炎球菌、炭疽桿菌、霍亂弧菌等有抑制作用
- 桂皮油、桂皮醛
  - 對結核桿菌、變形桿菌有抑制作用。

(5)對心血管系統作用

- 桂枝可減少心肌乳酸脫氫酶和磷酸肌酸激酶的釋放，減少脂質過氧化物 (LPO)生成，提升SOD活性。
- 桂枝水煎劑：
  - 可擴張週邊血管，改善微循環，並可加速體溫的恢復。
  - 注射給藥，能增加冠脈血流量，增加心肌營養血流量。
- 桂枝蒸餾液可降低大鼠離體心臟缺血再灌注心室顫動發生率，改善心功能。
- 桂皮醛在體外對血小板聚集有抑制作用，並有抗凝血酶作用。

2.其他藥理作用

- 桂枝具有明顯的鎮靜、抗驚厥作用
- 桂枝水提取物、總揮發油、桂皮醛：
  - 可使小鼠自主活動減少，增強巴比妥類藥物的催眠作用，對抗苯丙胺興奮中樞的作用，
  - 對小鼠藥物性驚厥(士的寧、煙鹼)和聽源性驚厥均有一定的對抗作用。
- 桂枝具有一定的利尿作用。
- 桂皮醛注射給藥有抗腫瘤作用。
- 桂皮醛能促進胃腸平滑肌蠕動，增強消化機能。
- 桂皮酸有利膽作用。

綜述

- 促發汗、解熱、鎮痛、抗發炎、抗過敏、抗病原微生物等作用是其發汗解肌功效的藥理學基礎，
- 對心血管系統的影響則是其溫通經脈功效的體現。
- 桂枝主要有效成分是揮發油。

現代應用

- 預防流行性感冒
  - 複方桂枝氣霧劑噴咽喉部。
- 風濕性關節炎
  - 以桂枝為主的複方製劑（桂枝茯苓丸）有較好效果。
- 低血壓症
  - 桂枝、甘草、附子各15g，代茶飲。

柴胡

- 傘形科植物：
  - 柴胡Bupleurum chinense DC.
  - 狹葉柴胡Buplerum scorzonerifolium Willd.的乾燥根。
- 主要成分：
  - 柴胡皂苷 (saikosaponins a、b、c、d四種)，
  - 甾醇 (主要為“α-菠菜甾醇”-spinasterol，尚有豆甾醇stigmasterol)，
  - 揮發油 (柴胡醇bupleurmol、丁香酚、己酸、7-十一酸內酯、對-甲氧基苯二酮等)，
  - 脂肪油 (油酸、亞麻油酸、棕櫚酸、硬脂酸等的甘油酯)
  - 多糖。
  - 生物鹼、黃酮類、山奈苷、葡萄糖、氨基酸等。
- 味苦，性微寒。歸肝、膽經。

柴胡
Bupleurum chinense DC.

狹葉柴胡
Bupleurum scorzonerifolium Willd.

與功效主治相關的藥理作用

- 功效
  - 和解表裡、疏肝、升陽。
- 主治
  - 感冒發熱，寒熱往來，胸脅脹痛，月經不調。
- 本草正
  - 柴胡，用此者用其涼散，平肝之熱。其性涼，故解寒熱往來，肌表潮熱，肝膽火炎，胸脅痛結，兼治瘡瘍，血室受熱；其性散，故主傷寒邪熱末解，溫病熱盛，少陽頭痛，肝經鬱證。

(1)解熱

- 中醫臨床用柴胡治療寒熱往來的半表半裡之熱有確切療效。
  - 相當於現代醫學的風濕熱、化膿性感染及瘧疾等。
- 柴胡煎劑、柴胡注射液、柴胡醇浸膏、揮發油及粗皂苷等對多種原因(如發酵酸奶、傷寒副傷寒菌苗)引起的動物實驗性發熱，均有明顯的解熱作用，並且可使正常動物的體溫降低。
- 解熱主要成分為柴胡皂苷、皂苷元A和揮發油。
  - 揮發油的解熱作用具有用量少、作用強及毒性小的特點。

(1)解熱

- 柴胡總揮發油中的丁香酚、己酸、7-十一酸內酯和對-甲氧基苯二酮是其解熱的主要成分。
  - cAMP是重要的發熱介質之一，可引起下視丘體溫調節中樞體溫調定點升高，造成機體發熱。
  - 柴胡揮發油可能作用於下視丘體溫調節中樞，抑制cAMP的產生或釋放，抑制體溫調定點的上移，使體溫下降。

(2)抗病原微生物

- 柴胡：
  - 對金黃色葡萄球菌、溶血性鏈球菌、霍亂弧菌、結核桿菌、鉤端螺旋體有一定的抑制作用；
  - 對流感病毒具有較強的抑制作用；
  - 可抑制肝炎病毒、牛痘病毒，對抗I型脊髓灰白質炎病毒導致細胞病變的作用。
- 柴胡注射液治療單純疱疹病毒性角膜炎有效，對流行性出血熱病毒有一定作用。
- 實驗性病毒性肺炎小鼠灌服柴胡水提取物，可顯著降低肺指數和死亡率。

(3)抗發炎

- 柴胡粗皂苷、柴胡皂苷、柴胡揮發油均有抗發炎作用。
- 柴胡皂苷對正常或去腎上腺大鼠由多種致炎劑引起的炎症反應均有抑制作用。
- 抗發炎作用機制：
  - 降低毛細血管通透性；
  - 抑制白血球游走；
  - 抑制肉芽組織增生。
- 柴胡皂苷：
  - 能興奮下視丘-腦下垂體-腎上腺皮質內分泌軸，促進腦下垂體分泌ACTH，增強糖皮質激素的抗發炎作用。
  - 可能還有直接抑制致炎物質釋放的作用。

(4)促進免疫功能

- 柴胡多糖、柴胡熱水提取物(高分子成分)能促進機體免疫功能。
- 柴胡多糖可增強庫氏(Kupffer)細胞吞噬功能，增強自然殺傷細胞的功能，提升病毒特異抗體滴度，提升淋巴細胞轉化率和皮膚遲發型超敏反應。
- 柴胡皂苷在小劑量時可促進脾細胞DNA合成和IL-2的產生，但劑量增大後則抑制DNA的合成。

(5)鎮靜、鎮痛、鎮咳

- 柴胡煎劑、總皂苷、柴胡皂苷元對中樞神經系統具有明顯抑制作用，可使動物的自發活動減少，條件反射抑制，延長巴比妥類藥物的睡眠時間，拮抗中樞激動劑(苯丙胺、咖啡因等)的作用。
- 正常人服用柴胡粗製劑也可出現嗜睡等中樞抑制現象。
- 柴胡煎劑、柴胡皂苷對多種實驗性疼痛動物模型呈現鎮痛作用。
- 柴胡皂苷可提升實驗動物的痛閾值，並且該作用可部分被naloxone所拮抗。
- 柴胡、柴胡粗皂苷、柴胡皂苷元有較好的鎮咳作用。
  - 柴胡總皂苷的鎮咳強度略低於可待因。
  - 柴胡皂苷元注射給藥，鎮咳效果良好。

(6)保肝、利膽、降血脂

- 柴胡、柴胡皂苷、柴胡醇、α-菠菜甾醇具有保肝作用，對多種原因(化學等)引起的動物實驗性肝損傷有一定的防治作用。
  - 能使ALT、AST降低，減輕肝細胞損傷，促進肝功能恢復正常。
  - 臨床研究顯示其降酶速度快，作用強。
  - 柴胡保肝作用以複方製劑效果更佳。
- 柴胡保肝機制可能在於：
  - 柴胡皂苷對生物膜(如線粒體膜)有直接保護作用；
  - 柴胡皂苷促進腦下垂體分泌ACTH，進而升高血漿皮質醇，並能拮抗外源性甾體激素對腎上腺的萎縮作用，提升機體對非特異性刺激的抵抗能力；
  - 促進肝細胞DNA合成，
  - 抑制細胞外基質的合成。

(6)保肝、利膽、降血脂

- 柴胡水浸劑和煎劑具有明顯的利膽作用，可使實驗動物的膽汁排出量增加，降低膽汁中膽酸、膽色素和膽固醇的含量。
  - 醋炙柴胡的利膽作用最強。
  - 柴胡所含黃酮類物質可能是其利膽成分。

- 柴胡影響脂質代謝的主要成分為柴胡皂苷、皂苷元a和b、柴胡醇、α-菠菜甾醇。
- 柴胡皂苷肌內注射可使實驗性高脂血症動物的膽固醇、甘油三酯和磷脂濃度降低，其中降低甘油三酯的作用最為明顯，還可加速14C-膽固醇及其代謝產物從糞便排泄。
- 柴胡醇、α-菠菜甾醇可降低高膽固醇血症動物的膽固醇濃度。
- 柴胡對正常動物的血脂濃度無明顯影響。

(7)對內臟平滑肌的作用

- 柴胡粗皂苷可明顯增強乙醯膽鹼對豚鼠、家兔離體腸肌的收縮作用，而其複方製劑又可對抗乙醯膽鹼、氯化鋇、組織胺等所致的腸肌痙攣。
- 柴胡粗皂苷、柴胡多糖對多種實驗性胃黏膜損傷模型有保護作用。
- 柴胡有興奮子宮的作用。

其他藥理作用

- 影響物質代謝酶：
  - 柴胡皂苷a、c、d混合物可促進動物體內蛋白質合成；
  - 柴胡皂苷能使肝糖原合成增加，促進葡萄糖的利用，抑制脂肪的分解。
- 抗輻射作用：
  - 柴胡多糖注射給藥對接受γ射線照射的小鼠具有保護作用，可提升存活率，保護脾臟、骨髓等組織，並加快胸腺細胞合成DNA的速度。
- 對腎臟的影響：
  - 給水負荷大鼠灌服一定劑量的柴胡能抑制排尿，而大劑量時則促進排尿。

其他藥理作用

- 柴胡可降低SOD的活性
- 柴胡水提取物有抗癲癇作用
- 柴胡皂苷：
  - 對艾氏腹水癌細胞有抑制作用；
  - 對胰蛋白酶有較強的抑制作用。

綜述

- 和解表裡功效的藥效學基礎
  - 解熱、抗病原微生物、抗發炎、促進免疫功能等作用；
- 疏肝解鬱功效
  - 保肝、利膽、降脂、鎮靜、鎮痛等作用有關
- 升舉陽氣功效
  - 對內臟平滑肌的興奮作用有關。
- 主要有效成分
  - 柴胡皂苷、揮發油和多糖。

現代應用

- 發熱：對感冒、流感、肺炎、支氣管炎、扁桃體炎、瘧疾等引起的發熱。
- 病毒性肝炎：複方柴胡製劑(如小柴胡湯等)治療急慢性肝炎，對改善症狀，恢復肝功能有較好效果。
- 咳嗽：治療感冒、急慢性支氣管炎、肺炎所致的咳嗽。
- 高脂血症：可明顯降低甘油三酯。
- 對病毒性角膜炎、扁平疣、尋常疣有一定療效。

不良反應

- 柴胡毒性較小。
- 柴胡煎劑、柴胡皂苷有溶血作用，口服時此效應不明顯。
- 人口服較大劑量可出現嗜睡、工作效率降低，甚至深睡等現象，有的出現腹脹、食慾減退。

葛根

- 豆科植物：
  - 野葛Pueraria lobata (Willd.)Ohwi.
  - 甘葛藤P. thomsonii Benth.的乾燥根。
- 主要成分：
  - 黃酮類化合物，含量為0.06%-12.30%，有大豆苷(daidzin，黃豆苷)、大豆苷元(daidzein，黃豆素)、葛根素(puerarin)等。
  - 尿囊素、β-谷甾醇、澱粉等。
- 味甘、辛，性涼。歸脾、胃經。

野葛

Pueraria lobata (Willd.)Ohwi.

甘葛藤

Pueraria thomsonii Benth.

與功效主治相關的藥理作用

- 功效：升陽解肌、透疹止瀉、除煩止渴。
- 主治：外感發熱頭痛、項背強痛，口渴，消渴，麻疹不透，熱痢，泄瀉。
- 藥品化義
  - 葛根，根主上升，甘主散表，....能理肌肉之邪，開發腠理而出汗，屬足陽明胃經藥，治傷寒發熱，鼻乾口燥，目痛不眠，瘧疾熱重。...其性味甘涼，治胃虛熱渴，酒毒嘔吐，胃中鬱火，牙痛口臭。

(1)解熱

- 葛根所含黃酮類物質是其解熱作用的成分。
- 葛根煎劑、葛根乙醇浸膏、葛根素等對實驗性發熱模型動物均有解熱作用，葛根素作用較突出。
- 野葛有顯著的解熱作用，與阿司匹林相似，特點為起效快，解熱作用在藥後3~5小時最明顯。
- 甘葛藤作用較弱，作用維持時間短。
- 野葛和葛根素可使體溫降至正常以下。

(1)解熱

- 葛根解熱可能機制：
  - 葛根使皮膚血管擴張，促進血液循環而增加散熱。
  - 葛根素透過阻斷中樞部位的β受體而使cAMP生成減少，產生解熱效應。

(2)降血糖、降血脂

- 中醫消渴證相當於現代醫學的糖尿病。
- 葛根煎劑有輕度降低血糖的作用。
- 葛根素是葛根降糖有效成分。
- 葛根素給四氧嘧啶性高血糖小鼠灌胃，可使血糖降低，作用可維持24小時，並能改善糖耐量；但對腎上腺素性高血糖小鼠，無對抗作用。

(2)降血糖、降血脂

- 葛根素對大鼠晶體醛糖還原酶 (aldose reductase, AR)有抑制作用，對防治糖尿病併發症有積極意義。
- 葛根素注射給藥可明顯降低血清膽固醇。對大鼠飲酒所致血清載脂蛋白A_1(Apo A_1)降低及甘油三酯升高，葛根口服液有顯著對抗作用。

(3)對內臟平滑肌作用

- 葛根含有收縮和舒張內臟平滑肌的不同成分。
  - 對離體豚鼠回腸，葛根丙酮提取物及甲醇提取物有鬆弛作用，
  - 甲醇提取物作用相反。
- 丙酮提取物及甲醇提取物2對離體大鼠子宮有罌粟鹼樣鬆弛作用。
- 葛根去黄酮後的水提取物MTF-101對離體小鼠小腸有乙醯膽鹼樣作用。
- 黄豆苷元對小鼠離體腸平滑肌有明顯解痙作用，可對抗乙醯膽鹼所致的腸痙攣。

(1)抗心肌缺血

- 葛根總黃酮、葛根素是影響心臟功能的成分。
- 葛根素是一種β受體阻斷劑，給麻醉犬靜脈注射後，
  - 可使心率明顯減慢，心輸出量減少；
  - 使正常和痙攣狀態的冠脈擴張，增加冠脈血流量；
  - 改善心電圖缺血反應。
- 葛根的水煎劑、醇浸膏均能對抗腦下垂體後葉引發的動物心肌缺血。
- 葛根素對缺血心肌及缺血再灌注心肌有保護作用，可減少心肌乳酸生成，降低耗氧量和肌酸激酶釋放量，保護心肌超微架構，改善微循環障礙，減少TXA_2生成。

(2)抗心律失常

- 葛根乙醇提取物、黃豆苷元灌胃後能明顯對抗氯化鋇、烏頭鹼所致大鼠心律失常，預防氯化鈣所致大鼠心室顫動，降低氯仿所致小鼠心室顫動發生率，縮短大鼠結紮冠脈後室顫發作時間。
- 葛根素灌胃及靜脈注射能明顯對抗烏頭鹼、氯化鋇所致心律失常，靜脈注射後可明顯延長心肌動作電位時程及有效不應期。

(2)抗心律失常

- 葛根素靜脈注射能顯著對抗氯仿-腎上腺素誘發的兔心律失常，提升哇巴因所致豚鼠室性早搏、室性心搏過速的閥值，對室顫閾值也有提升作用。
- 葛根抗心律失常機制可能透過影響心肌細胞膜對K^+、Na^+ 、Ca^{2+}的通透性，進而降低心肌興奮性、自律性及傳導性，也與β受體阻斷效應有關。

(3)擴血管、降血壓

- 葛根總黃酮、葛根素靜脈注射後，對週邊血管具有一定的擴張作用。
- 葛根水煎劑、醇浸膏、葛根總黃酮、葛根素、大豆甘元對高血壓模型動物均有一定的降血壓效果。
- 葛根素、大豆苷元能降低血漿腎素及血管緊張素濃度，葛根素尚可減少血漿兒茶酚胺含量。

(3)擴血管、降血壓

- 葛根降血壓可能機制：
  - β受體阻斷效應；
  - 抑制腎素-血管緊張素系統；
  - 影響血漿兒茶酚胺代謝；
  - 改善血管的反應性 (順應性)。
- 葛根醇浸膏及葛根素能減弱去甲腎上腺素或乙醯甲膽鹼對高血壓犬的升壓或降血壓反應。

(3)擴血管、降血壓

- 葛根總黃酮、葛根素給麻醉犬注射用藥可使腦血管阻力下降，腦血流量增加，腦循環改善。
- 葛根能減弱乙醯甲膽鹼所致的腦內動脈擴張和去甲腎上腺素所致的腦內動脈收縮，使處於異常狀態的腦血管功能恢復至正常濃度。
- 葛根素靜脈注射對去甲腎上腺素引起的微循環障礙具有對抗作用，可加快血流速度。
- 葛根、葛根素尚可改善視網膜微循環。

(4)改善血液流變性和抗血栓形成酶

- 在體外葛根素能抑制ADP誘導的人及動物血小板聚集。
- 給動物灌服葛根總黄酮能降低全血黏度和血小板黏附率，明顯抑制ADP誘導的體內血栓形成。

(5)促進記憶

- 葛根水煎劑、葛根總黃酮、醇提取物灌胃可對抗動物實驗性記憶獲得障礙和記憶再現障礙。
- 葛根總黃酮連續灌服可顯著改善D-半乳糖所致亞急性衰老小鼠的記憶功能。
- 在丫形迷宮試驗中能劑量倚賴性對抗東蒗菪鹼(scopolamine)引起的自主選擇能力降低。
- 葛根總黃酮、葛根素有抗氧化作用，可減少組織malonyldialdehyed (MDA)、LPO含量，增加SOD活性。
- 葛根總黃酮、葛根素、大豆苷元、多糖等顯示有抗實驗性腫瘤的作用。

綜述

- 解肌退熱、除煩止渴功效的藥理學基礎：擴張血管、促進血液循環、解熱、降糖、降脂、對內臟平滑肌作用。
- 活血通脈功效：對心腦血管系統等作用。
- 葛根主要有效成分是葛根黃酮。

現代應用

- ❖ 偏頭痛。
- ❖ 突發性耳聾　。
- ❖ 冠心病、心絞痛。
- ❖ 高血壓病。
- ❖ 感冒、頭痛、發熱：
  - 常用葛根複方製劑（如葛根湯、桂枝加葛根湯）。
- ❖ 痲疹初起、發熱、疹出不暢：用升麻葛根湯。
- ❖ 葛根素：
  - 糖尿病、腦血栓形成、青光眼、視神經損傷。

不良反應

- 葛根口服毒性極小。
- 葛根醇浸劑、葛根總黃酮、葛根素給小鼠靜脈注射LD50分別為2.1 g/kg、1.6 g/kg、738 mg/kg。

細　辛

- 馬兜鈴科植物的乾燥全草：
  - 北細辛Asarum heterotropoides Fr.Schmidt var. mandshuricm (Maxim)Kitag.、
  - 漢城細辛Asarum Sieboldii Miq.var.Smulense Nakai
  - 華細辛Asarum Sieboldii Miq. 。
- 主要成分：
  - 揮發油(全草含2.39%-3.80%) ：甲基丁香酚(methyl eugenol)、α-蒎烯(α-pinene)、β-蒎烯(β-pinene)、黃樟醚(safrole) 、愛草腦(estragole)、細辛醚(asarone)、檸檬烯(limonene)等。
  - 辛味成分：主要是異丁基十二烷四醯胺(isobutyldodecatetraenamine)。
  - 去甲烏藥鹼(higenamine)、多種氨基酸和無機元素。
- 味辛，性溫。歸心、肺、腎經。

漢城細辛
Asarum Sieboldii Miq.var.*Smulense* Nakai

北細辛
Asarum heterotropoides Fr.Schmidt var. *mandshuricm* (Maxim)Kitag

華細辛
Asarum Sieboldii Miq.

與功效主治相關的藥理作用

- 功效：
  - 祛風、散寒、行水、開竅。
- 主治：
  - 風寒感冒，頭痛，牙痛，鼻塞鼻淵，風濕痺痛，痰飲咳喘。
- 長沙藥解：
  - 細辛，斂降沖逆而止咳，驅寒濕而蕩濁，最清氣道，並通水源，溫燥開通，利肺胃之壅阻，驅水飲而逐濕寒，潤大腸而行小便，善降沖逆。其諸主治，收眼淚、利鼻壅、去口臭、除齒痛、通經脈，皆其行鬱破結，下沖降逆之力也。

(1)解熱

- 細辛揮發油灌胃對多種原因引起的家免實驗性發熱有明顯解熱作用，腹腔注射對正常豚鼠及大鼠有一定降溫作用。
- 細辛揮發油腹腔注射對人工發熱大鼠有解熱效應，並可維持5小時以上。
- 解熱作用部位可能是在中樞神經系統。

(2)鎮靜、鎮痛

❖ 細辛揮發油：

- 腹腔注射可使小鼠、豚鼠安靜，自主活動減少，行走稍有不穩，呼吸輕度減慢。隨劑量加大，動物翻正反射消失，中樞抑制加強，最後可因呼吸停止而死亡。
- 與閾下催眠劑量的戊巴比妥鈉和水合氯醛均有協同催眠作用。
- 灌胃或腹腔注射對動物物理性或化學性疼痛反應均有顯著對抗作用，
- 腹腔注射能明顯提升動物痛閾值。

(3)抗發炎

❖ 細辛揮發油：

- 灌胃或注射給藥均有明顯的抗發炎作用，可抑制炎症發生過程的滲出、白血球游走及肉芽組織增生。
- 對甲醛、角叉菜膠、酵母、蛋清引起的大鼠足蹠腫脹，巴豆油引起的小鼠耳腫脹，組織胺或前列腺素E引起的毛細血管通透性增加，大鼠注射角叉菜膠引起的白血球游走及大鼠肉芽腫增生均有明顯抑制作用，並能降低炎症組織及滲出液中組織胺含量。
- 對正常及切除腎上腺大鼠均有抗發炎效應。

(3)抗發炎

- 去甲烏藥鹼、細辛水提取物亦有較好的抗發炎作用。
- 細辛抗發炎機制：
  - 具有ACTH樣作用，增強腎上腺皮質功能
  - 抑制炎性介質的釋放
  - 對抗發炎性介質的作用
  - 抗氧化、清除自由基作用

(4)抗過敏反應

- 細辛水及乙醇提取物可使速發型過敏反應過敏介質釋放量減少40%以上。
- 細辛乳劑給小鼠灌胃，可使胸腺萎縮，脾臟指數降低，T細胞數和溶血空斑數減少。
- 細辛煎劑灌服可明顯降低豚鼠α-醋酸奈酯酶(ANAE)陽性T細胞的百分率。
  - 與影響淋巴細胞亞群的分佈有關。

(5)對呼吸系統作用

- 細辛揮發油、甲基丁香酚、細辛醚均可鬆弛支氣管平滑肌而產生平喘作用。
- 細辛揮發油可對抗組織胺、乙醯膽鹼引起的支氣管痙攣。
- 細辛醚有一定的祛痰作用。
- 細辛醇浸劑能使離體肺灌流量先有短暫降低，而後持續增加。

(6)對心血管系統作用

- 細辛醇提取物、去甲烏藥鹼可使麻醉犬心率加快，心輸出量增加，平均動脈壓升高。
  - 應用β受體阻斷劑後，細辛增加心輸出量的作用仍然存在。
- 細辛揮發油靜脈注射可對抗腦下垂體後葉素所致兔急性心肌缺血，並提升小鼠減壓耐缺氧能力。
- 細辛對實驗性心源性休克犬能提升其平均動脈壓、左室室內壓峰值和冠脈血流量等。
- 細辛揮發油給麻醉犬、貓靜脈注射，可見降血壓反應，但其水煎劑卻有升壓效果，該效應可能與所含去甲烏藥鹼有關。

(7)抗病原微生物作用

- 細辛揮發油對革蘭陽性菌、枯草桿菌、傷寒桿菌及多種真菌(黃麴黴菌、黑麴黴菌、白色念珠菌等)有一定抑制作用，抗菌有效成分為黃樟醚。
- α-細辛醚對呼吸道合胞病毒的增殖有抑制性效應。

2.其他藥理作用

- 細辛揮發油：
  - 具有表面麻醉以及浸潤麻醉作用。
  - 對家兔離體子宮及腸平滑肌具有小劑量興奮，大劑量抑制的作用。
- 細辛水浸劑灌胃可降低心臟組織LPO含量。
- 細辛尚有增強脂質代謝、升高血糖等作用。

綜述

- 解熱、鎮靜、鎮痛、對心血管系統影響、抗病原微生物等作用是其祛風散寒功效的藥理學基礎；
- 抗發炎、抗免疫、對呼吸系統等作用可能與開竅功效有關。
- 主要有效成分是揮發油。

現代應用

- 頭痛。
- 慢性支氣管炎。
- 心絞痛。
- 緩慢型心律失常。
- 局部麻醉。

不良反應

- 細辛煎劑給小鼠灌胃、靜脈注射LD50分別為12.38 g/kg、0.78 g/kg。
- 細辛揮發油小鼠腹腔注射LD50為0.55 ml/kg。
- 細辛揮發油所含黃樟醚毒性較大，將其摻入飼料中，兩年後28%大鼠出現肝癌。
- 細辛少量長時間餵食貓及家畜，可引起動物肝腎脂肪變性。
- 細辛每日用量超過20g時，可有口唇、舌尖和趾指發麻感，停藥後可以恢復。
- 細辛對腎臟有一定毒性，腎功能不全者應慎用。

Discussion